

# СИНТЕЗ 1,4-ДИГІДРО-2Н-ПІРИДО[2,3-*b*]ПІРАЗИНОНІВ ТА ДОСЛІДЖЕННЯ ЇХ ПЕРЕГРУПУВАННЯ

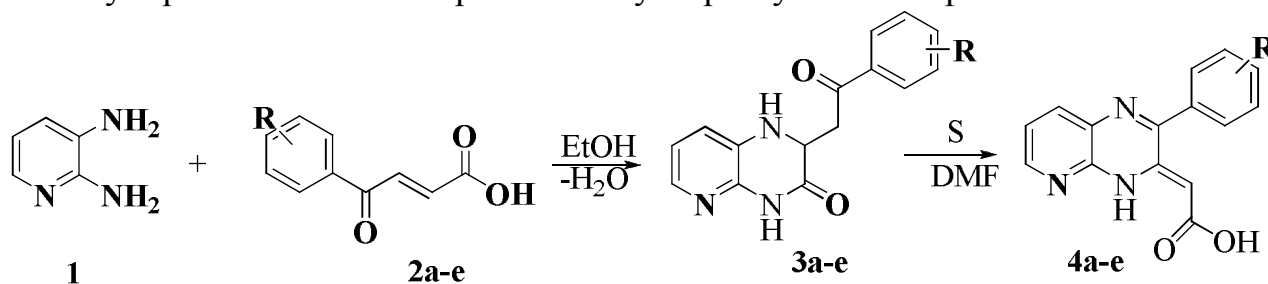
*Мілютіна М. Б., Колос Н. М.*

Харківський національний університет імені В.Н. Каразіна

*miamasha@mail.ru*

Останнім часом зростає цікавість до  $\beta$ -ароїлакрилових кислот, як до порівняно простих будівельних блоків, що можуть бути вихідними сполуками у синтезі шестичленних азотовмісних гетероциклів [1,2]. Відомо, що *o*-фенілендіамін в реакціях з  $\beta$ -ароїлакриловими кислотами утворює похідні 3-фенацилхіноксалін-2-онів, серед яких перспективним є пошук антидискінетиків, респіраторних аналептиків, антагоністів інтерлейкіна, вазодилаторів та антипротозоїків [2].

Метою даного дослідження стало вивчення продуктів взаємодії  $\beta$ -ароїлакрилових кислот **2a-e** з 2,3-діамінопіридином **1**. Нами встановлено, що нетривале нагрівання вихідних компонент в етанолі приводить до утворення 2-(2-оксо-2-фенілетил)-1,4-дигідро-2Н-піридо[2,3-*b*]піразин-3-онів **3a-e**, будову яких підтверджено фізико-хімічними методами. Оптимізовано методику синтезу піразинонів **3** з використанням ультразвукового опромінення



**2-4a-e**; a R= 4-Me, b R=4-Br, c R= 4-SO<sub>2</sub>Me, d R=2-Cl, e R=2-F

Рис. 1. Синтез та перегрупування 2-(2-оксо-2-(R-феніл))-1,4-дигідро-2Н-піридо[2,3-*b*]піразин-3-онів

Показано, що сполуки **3** при нагріванні в ДМФА в присутності окисників – молекулярного бромоводню або сірки перегруповуються в кислоти **4** з високими виходами. Запропоновано ймовірний механізм такого перегрупування.

За допомогою комп'ютерної програми PASS проведено віртуальний скринінг біологічної активності отриманих сполук. Зокрема, вказані сполуки є перспективними інгібіторами ряду ферментів: глікозилфосфатидилінозитол фосфоліпаз, карбоксипептидаз та фталат 4,5-діоксигеназ.

[1] Берьозкіна Т. В. Формування шестичленних азагетероциклів в реакціях  $\beta$ -ароїлакрилових кислот з бінуклеофілами: дис. канд. хім. наук : 02.00.03 / Берьозкіна Тетяна Володимирівна. - Харків, 2003. – 144 с.

- [2] Коваленко Л. Ю. Естери та амідн  $\beta$ -ароїлакрилових кислот в реакціях з 1,3- та 1,4-бінуклеофілами: дис. канд. хім. наук : 02.00.03 / Коваленко Людмила Юріївна. – Харків, 2008. – 132 с.
- [3] <http://www.ibmc.msk.ru/PASS>.